

## ФУНКЦИОНАЛИЗАЦИЯ 1,2-ДИФЕНИЛПИРАЗОЛИДИН-3,5-ДИОНА

Худина Ольга Георгиевна, Бургарт Я.В., Салютин В.И.

УрО РАН Институт органического синтеза им. И.Я. Постовского,  
620137, Россия, г. Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, 22,  
kog@ios.uran.ru

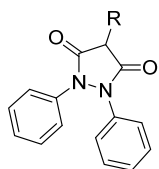
### Введение:

Известный нестероидный противовоспалительный препарат *бутадион* (*фенилбутадион*) и его структурные аналоги (*кетазон*, *трибузон*), модифицированные по положению 4 пиразолидинового цикла, оказывают анальгетическое, жаропонижающее и противовоспалительное действие. Их назначают при ревматоидном артрите, анкилозирующем спондилите, артрозе, при воспалительных заболеваниях кровеносных сосудов и при подагре. Однако *бутадион* и его аналоги имеют многочисленные противопоказания, что обуславливает целесообразность поиска производных 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-диона с минимальными побочными эффектами.

### Результаты:

Нами были получены полифторалкилсодержащие структурные аналоги *кетазона* и *трибузона*. Найдено, что 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-дион **1** вступает в конденсацию Кнёвенагеля с полифторалкилзамещенными 3-оксоэфирами **2a,b** в присутствии катализатора *L*-пролина с образованием этил (2*E*)-3-(пиразолидин-4-ил)-3-полифторалкилпроп-2-еноатов **3a,b**.

Реакция Кнёвенагеля 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-диона **1** с этил 3,3,3-трифтор-2-оксопропаноатом **4** в присутствии основания (*L*-пролин, пиперидин) останавливается на стадии присоединения эфира **4** по активированному метиленовому фрагменту пиразолидинона **1** с образованием аддуктов **5**, **6**. При использовании эквимолярного количества пиперидина в качестве основания конечным продуктом реакции является соль **6** пиперидина с этил 2-(пиразолидин-4-ил)-3,3,3-трифтор-2-гидроксипропаноатом **5**.



R = Bu (*бутадион*),  
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COMe (*кетазон*),  
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COBu<sup>t</sup> (*трибузон*)

Синтезированные соединения **3**, **5** представляют интерес для изучения их анальгетического и противовоспалительного действия.

### Благодарность:

Работа выполнена в рамках государственного задания АААА-А19-119011790130-3.

